

性 状：無色プリズム状晶

実施例 1

メチル N α -メチルトリプトファンネート

1. 0 g を、乾燥ジクロロメタン 30 ml に加え、0℃、アルゴン気流中、攪拌しながら、これに乾燥トリエチルアミン 1.63 ml を加えた。次に 3, 4, 5-トリメトキシベンゾイルクロライド 901 mg を徐々に加えた後、室温にて 40 分間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、食塩水、1 N 塩酸、食塩水、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液；クロロホルム：メタノール＝200：1）にて精製して、メチル N α -メチル-N α -(3, 4, 5-トリメトキシベンゾイル)トリプトファンネート 1.459 g を得た。

IR (CDCl₃, ν : cm⁻¹)3 4 7 5、1 7 3 8、1 6 2 7、1 5 8 5、
1 4 1 1、1 2 3 8、1 2 1 5、1 1 2 8NMR (CDCl₃) δ :

7.32 (d, J = 8.4 Hz)
7.65 (broad)、8.42 (broad)
8.44 (broad)、2.82 (broad s)
3.10 (broad s)
3.50 (3H, broad s)
3.63 (3H, broad s)
3.78 (3H, s)、3.84 (3H, s)
3.1-3.7 (2H, m)
4.90 (m)、5.56 (m)
6.07 (broad)、6.22 (broad)
6.93 (m)、7.15 (m)

MS (マススペクトル、70 eV): m/z

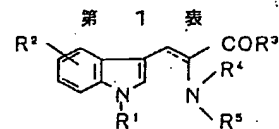
426 (M⁺)、226、225、202、
201、196、195、170、152、
131、130

- 95 -

実施例 2～58

適当な出発原料を用いて、実施例 1 と同様にし、下記第 1 表に示す各化合物を得た。

また得られた各化合物の性状（融点、NMR、IR、MS）及び結晶形（再結晶溶媒）を第 2 表に示す。
















実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	側鎖の結合
2	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₄ -Br	1
3	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₄ -C ₆ H ₅	1
4	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₃ (NO ₂) ₂	1
5	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₃ (NO ₂) ₂	1
6	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₃ (NO ₂) ₂	1
7	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₄ -CN	1
8	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-C ₆ H ₄ -I	1












- 97 -

-259-



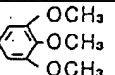





- 98 -

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	側鎖の結合
9	H	H	OCH ₃	CH ₃	-COCH=CH- 	1
10	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	1
11	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
12	H	H	OH	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
13	H	H	-N  - 	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
14	H	H	-N  O	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
15	H	H	-NH 	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
16	H	H	-N  NCH ₃	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1












- 99 -

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	側鎖の結合
17	H	H	-N 	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
18	H	H	H-N 	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
19	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
20	-CH ₂ CH CH ₂	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
21		H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -Cℓ	1
22	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -OCH ₃	1
23	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -OCH ₃ OCH ₃	1
24	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -F	1

- 100 -

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	側鎖の結合
25	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -NO ₂	1
26	H	H	OCH ₃	CH ₃	-SO ₂ -  -CH ₃	1
27	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	2
28	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -Br	2
29	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	2
30	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	2
31	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	2
32	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	2

- 101 -

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	側鎖の結合
33	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -CN	2
34	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO-  -I	2
35	H	H	OH	CH ₃	-CO-  -Cℓ	2
36	H	H	OCH ₃	CH ₃	-COC=C- 	2
37	H	H	OCH ₃	CH ₃	-CO- 	2
38	H	H	-NH 	CH ₃	-CO- 	2
39	H	H	-N  O	CH ₃	-CO-  -Cℓ	2
40	H	H	-NH 	CH ₃	-CO-  -Cℓ	2

- 102 -